

(19)日本国特許庁 (JP)

## (12) 特許公報 (B2)

(11)特許番号

第2944669号

(45)発行日 平成11年(1999)9月6日

(24)登録日 平成11年(1999)6月25日

(51)Int.Cl.<sup>6</sup>  
C 07 K 7/23  
A 61 K 31/00  
38/04  
C 07 K 1/02  
1/04

識別記号

F I  
C 07 K 7/23  
A 61 K 31/00  
C 07 K 1/02  
1/04  
14/59

請求項の数9(全21頁) 最終頁に続く

(21)出願番号 特願昭63-177288

(22)出願日 昭和63年(1988)7月18日

(65)公開番号 特開平1-34997

(43)公開日 平成1年(1989)2月6日

審査請求日 平成7年(1995)7月14日

(31)優先権主張番号 074126

(32)優先日 1987年7月17日

(33)優先権主張国 米国(US)

(73)特許権者 999999999  
アスター・メディカ・アクチングゼルシ  
ヤフト  
ドイツ連邦共和国フランクフルト・ア  
ム・マイン 1・ヴァイスミユラーシュ  
トラーセ 45  
(72)発明者 アンドルウー・ブイ・シヤリー  
アメリカ合衆国ルイジアナ・メタイリ  
ー・カワネ・アヴェニュー 5025  
(72)発明者 サンダー・パジヤズ  
アメリカ合衆国ルイジアナ・ニュー・オ  
ーリーンズ・カラン・ブルーヴィード・  
ナンバー 5 ダブリュ  
(74)代理人 弁理士 矢野 敏雄  
審査官 新見 浩一

最終頁に続く

(54)【発明の名称】ペプチド、その製造法、該ペプチドを含有する、LHRH拮抗剤

1

2

(57)【特許請求の範囲】

【請求項1】式I:



〔式中、

Xは1～7個の炭素原子を有する脂肪族または脂環式カルボン酸の直鎖状または分枝鎖状の鎖からなるアシル基であるかまたはカルバイル基であり、

R<sup>1</sup>はD-またはL-Pro、D-Phe、D-Phe(4-Cl)  
またはD-Nal(2)であり、

R<sup>2</sup>はD-Phe(4-Cl)であり、

R<sup>3</sup>はD-TrpまたはD-Pal(3)であり、

R<sup>6</sup>はD-Cit、D-Hci、D-Cit(Q)またはD-Hci  
(Q)であり、

R<sup>10</sup>はGlyまたはD-Alaであり、

但し、QはC<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>-アルキル基であるものとする]で示

されるペプチドおよびその製薬学的に認容性の酸付加塩。

【請求項2】Xがアセチル基またはカルバモイル基であり、

R<sup>1</sup>がD-Nal(2)、D-またはL-Pro、D-PheまたはD-Phe(4-Cl)であり、

10 R<sup>2</sup>がD-Phe(4-Cl)であり、かつ

R<sup>3</sup>がD-TrpまたはD-Pal(3)である、請求項1記載のペプチド。

【請求項3】Xがアセチル基である、請求項1または2記載のペプチド。

【請求項4】Xがカルバモイル基である、請求項1また